

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005 年 2 月 17 日 (17.02.2005)

PCT

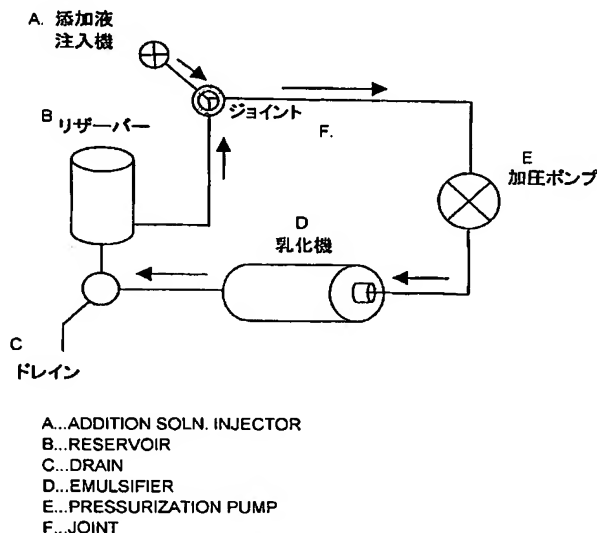
(10) 国際公開番号
WO 2005/013938 A1

- (51) 国際特許分類⁷: A61K 9/16, 47/18, 47/34, 47/44, A61P 1/00, 3/02, 3/06, 3/10, 5/00, 9/10, 9/12, 19/10, 25/04, 25/08, 25/20, 29/00, 31/04, 35/00, 37/08, B01F 17/52, 17/42, 17/14, 5/10
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2004/011518
- (22) 国際出願日: 2004 年 8 月 4 日 (04.08.2004)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2003-287943 2003 年 8 月 6 日 (06.08.2003) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エーザイ株式会社 (EISAI CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川 4 丁目 6 番 10 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 加藤 晃良 (KATO, Akira). 山口 武宏 (YAMAGUCHI, Takehiro). 野村 晃子 (NOMURA, Teruko). 小内 克巳 (ONAI, Katsumi).
- (74) 代理人: 古谷 聡, 外 (FURUYA, Satoshi et al.); 〒1030007 東京都中央区日本橋浜町 2 - 17 - 8 浜町花長ビル 6 階 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,

[続葉有]

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING DRUG ULTRAMICROPARTICLE AND APPARATUS THEREFOR

(54) 発明の名称: 薬物超微粒子の製造法及び製造装置



(57) Abstract: Drug fine particles of submicron size excelling in long-term dispersibility. In particular, there is provided a process for producing drug ultramicroparticles of 10 to 1000 nm average diameter, comprising (1) dissolving a drug in at least one type of good solvent or good mixed solvent to thereby obtain a drug-containing solution; (2) mixing the drug-containing solution with a, to the drug, poor solvent or poor mixed solvent that is miscible with the drug-containing solution prepared with the good solvent or good mixed solvent; and (3) without any pretreatment step for adjusting the average particle diameter of the drug to 100 μ m or less, directly emulsifying the resultant mixed solution at given treating pressure by the use of high-pressure homogenizer. There is further provided an apparatus therefor.

(57) 要約: 本発明は、長期間分散性に優れたサブミクロンサイズの薬物微小粒子を提供する。詳しくは、1) 薬物を 1 種類以上の良溶媒又は混合良溶媒に溶解させて薬物含有溶液を調製し、2) 前記薬物含有溶液を、前記薬物に対する貧溶媒又は混合貧溶媒であって前記の良溶媒又は混合良溶媒に溶解させた薬物含有溶液と混和可能な溶媒と混

[続葉有]



SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG).

- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

和し、3) 前記の調製した混和溶液を、前記薬物の平均粒子径を $100\mu\text{m}$ 以下に揃える前処理工程を経ることなく、直接に高圧ホモジナイザーを用いて一定の処理圧力で乳化処理してなる、平均粒子径が $10\text{nm}\sim 1000\text{nm}$ である薬物超微粒子の製造方法及びその製造装置を提供する。